

特 許 協 力 条 約

PCT

REC'D 11 NOV 2004

WIPO PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）
〔PCT36条及びPCT規則70〕

出願人又は代理人 の書類記号 ONF-4569PCT	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/06680	国際出願日 (日.月.年) 28.05.2003	優先日 (日.月.年) 03.10.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl ⁷ C07C65/40, C07C235/52, A61K31/192, 31/216, A61K31/402, 31/4035, 31/404, 31/41, 31/4184, 31/4402, 31/445, 31/472,		
出願人 (氏名又は名称) 小野薬品工業株式会社		

- この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。
法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。
- この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 8 ページからなる。
- この報告には次の附属物件も添付されている。
 - ☐ 附属書類は全部で _____ ページである。
☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）
☐ 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
 - ☐ 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。（実施細則第802号参照）

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- ☒ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☒ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☒ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 09.04.2004	国際予備審査報告を作成した日 13.10.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 井上 千弥子	4H 9356
電話番号 03-3581-1101 内線 3443		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

- ☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。
- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
- ☐ PCT規則12.4にいう国際公開
- ☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図
- ☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
- ☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図
- ☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
- ☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次にに関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 74-76

理由:

☐ この国際出願又は請求の範囲は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 74-76 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

☐

提出されていない。

☐

所定の基準を満たしていない。

☐

提出されていない。

☐

所定の基準を満たしていない。

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

☐ 提出されていない。

☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

第IV欄 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☒ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☐ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

請求の範囲1に記載された一般式(I)で示される化合物に共通する化学構造は、酸性基Zと、環Dと分岐した窒素原子または炭素原子であるJのみであり、その他は全て可変基であるが、かかる化学構造を有する化合物は、国際調査報告でも示したように、極めて多数のものが公知であり、該化学構造が重要な化学構造であるとは認められないから、本出願は単一性を有しない。

請求の範囲1等には、請求の範囲で定義されるところの、式I-J, I-K-1-1, I-K-1-2, I-N, I-L, I-O-1-1, I-O-1-2, I-O-1-3, I-O-1-4, I-O-1-5, I-M-1-1, I-M-1-2, I-M-1-3, I-A, I-B, I-C, I-D, I-Eの18の発明が存在するものと認められる。

国際予備審査機関が発明の単一性の要件を満たすと考える範囲は、次のとおりである。

請求の範囲1, 2, 69-73, 77-80

国際予備審査機関が主要な発明に関すると考える国際出願の部分は、次のとおりである。

請求の範囲1, 2, 69-73, 77-80

4. したがって、国際出願の次の部分について、この報告を作成した。

- ☐ すべての部分
- ☒ 請求の範囲 1, 2, 69-73, 77-80 に関する部分

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)	請求の範囲		有 無
	請求の範囲	1, 2, 69-73, 77-80	
進歩性(IS)	請求の範囲		有 無
	請求の範囲	1, 2, 69-73, 77-80	
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲		有 無
	請求の範囲	1, 2, 69-73, 77-80	

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1: WO 02/29001 A1(UNIVERSITY OF VIRGINIAN PATENT FOUNDATION) 2002.04.11

文献2: WO 95/12572 A1(ABBOTT LABORATORIES) 1995.05.11

文献3: EP 341081 A1(ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 1989.11.08

文献4: WO 93/12095 A1(PFIZER INC.) 1993.06.24

文献5: JP 56-90067 A(北陸製薬株式会社) 1981.07.21

文献6: WO 02/62798 A1(DR. REDDY'S RESEARCH FOUNDATION) 2002.08.15

文献7: WO 99/8501 A1(DR. REDDY'S RESEARCH FOUNDATION) 1999.02.25

文献8: JP 11-158144 A(エスエス製薬株式会社) 1999.06.15

文献9: JP 10-287634 A(大塚製薬株式会社) 1998.10.27

文献10: WO 02/646 A1(SMITHKLINE BEECHAM CORPORATION) 2002.01.03

文献11: WO 01/206 A1(DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 2001.01.04

文献12: EP 573271 A1(ELI LILLY AND COMPANY) 1993.12.08

文献13: EP 390215 A1(WAKUNAGA SEIYAKU KABUSIKI KAISYA) 1990.10.03

請求の範囲1、2、69は、国際調査報告で引用した文献1-13により、また、請求の範囲70-73、77-80は、同文献1により、新規性、進歩性を有しない。

請求の範囲1記載の化合物、及び、それがプロドラッグまたは医薬組成物の有効成分として有用なことは、文献1-13に記載されており、さらに、それが、LP-A受容体拮抗剤として有用なことは、文献1に記載されている。

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 02/92068 A1 [EX]	(21. 11. 2002)	(09. 05. 2002)	(10. 05. 2001)

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

第Ⅷ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

<調査の対象について>

請求の範囲 1 に記載された一般式(I)で示される化合物に共通する化学構造は、酸性基Zと、環Dと分岐した窒素原子または炭素原子であるJのみであり、その他は全て可変基であるが、かかる化学構造を有する化合物は、上記したように極めて多数のものが公知であり、該化学構造が重要な化学構造であるとは認められないから、本出願は単一性を有しない。

さらに、請求の範囲 69-73、77-80 に記載された発明は、上記一般式(I)で示される化合物を含有する医薬組成物の発明であるが、上述したように一般式(I)で示される化合物は極めて多数かつ多様な化合物を包含するものであるのに対して、明細書中において薬理活性の裏付けがあるのは、特定の化学構造を有するごく限られたものにすぎない。そして、一般式(I)で示される化合物を含有する医薬組成物は多数公知であり、請求の範囲 69-73、77-80 の全ての範囲を調査し、全ての先行技術文献を掲げるのは極めて困難である。したがって、国際調査は、明細書に裏付けのある化合物を含有する医薬組成物を中心に行った。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 欄の続き

国際特許分類 (IPC) の続き

A61K31/517, 31/5415,
A61P1/16, 3/04, 5/00, 5/16, 9/00, 9/10,
A61P11/00, 13/02, 13/08, 13/12, 17/00,
A61P17/06, 25/00, 25/02, 27/02, 27/06,
A61P29/00, 35/00, 35/02, 35/04, 37/00,
A61P43/00